

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



03 JUN 2005

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
24. Juni 2004 (24.06.2004)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2004/052852 A1 not Sk

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: C07D 207/34,
A61K 31/40, 31/402, 31/4025, C07D 401/06, 401/12,
403/06, 403/12, 405/12, 413/06, 405/06

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von
US): BAYER HEALTHCARE AG [DE/DE]; 51368 Lev-
erkusen (DE).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2003/013278

(72) Erfinder; und

(22) Internationales Anmeldedatum:
26. November 2003 (26.11.2003)

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): ZIMMERMANN,
Holger [DE/DE]; Katenerberger Schulweg 53, 42113
Wuppertal (DE). BRÜCKNER, David [DE/DE]; Fis-
cherstr. 15, 45128 Essen (DE). HEIMBACH, Dirk
[DE/DE]; An der Kaiserburg 13, 40629 Düsseldorf
(DE). HENNINGER, Kerstin [DE/DE]; Claudiusweg
7, 42115 Wuppertal (DE). HEWLETT, Guy [GB/DE];
Krutscheider Weg 96, 42327 Wuppertal (DE). ROSEN-
TRETER, Ulrich [DE/DE]; Obere Rutenbeck 6, 42349
Wuppertal (DE). SCHOHE-LOOP, Rudolf [DE/DE];
Arndtstr. 10 a, 42327 Wuppertal (DE). BAUMEISTER,

(25) Einreichungssprache: Deutsch

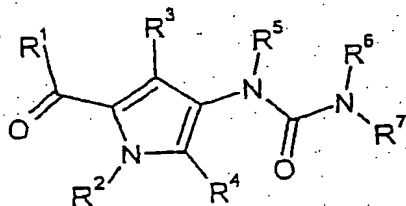
(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
102 57 358.1 9. Dezember 2002 (09.12.2002) DE

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: 3-PYRROLYL UREA DERIVATIVES AND THEIR USE AS ANTIVIRAL AGENTS

(54) Bezeichnung: 3-PYRROLYL-HARNSTOFF-DERIVATE UND IHRE VERWENDUNG ALS ANTIVIRALE MITTEL



(I)

(57) Abstract: The invention relates to substituted pyrroles of formula (I), in which: R¹ represents -OR⁸ or -NR⁹R¹⁰; R² represents hydrogen, C₁-C₆ alkyl or aryl, whereby R² as an alkyl can be substituted with 0, 1, 2 or 3 substituents R²⁻¹ independently of one another, selected from the group comprising halogen, hydroxy, C₁-C₆ alkoxy, hydroxycarbonyl, C₁-C₆ alkoxy carbonyl, C₁-C₆ alkyl carbonyloxy, amino, C₁-C₆ alkylamino, aminocarbonyl, C₁-C₆ alkylaminocarbonyl, C₃-C₈ cycloalkyl, a 5- to 10-membered heterocyclyl, C₆-C₁₀ aryl, phenoxy

and a 5- to 10-membered heteroaryl and whereby R² as an aryl can be substituted with 0, 1, 2 or 3 substituents R²⁻² independently of one another, selected from the group comprising halogen, hydroxy, nitro, cyano, trifluoromethyl, trifluoromethoxy, C₁-C₆ alkyl, C₁-C₆ alkoxy, hydroxycarbonyl, C₁-C₆ alkoxy carbonyl, amino, C₁-C₆ alkylamino, aminocarbonyl, C₁-C₆ alkylaminocarbonyl, C₃-C₈ cycloalkyl, a 5- to 10-membered heterocyclyl, C₆-C₁₀ aryl and a 5- to 10-membered heteroaryl; R³ and R⁴ independently of one another represent hydrogen or C₁-C₆ alkyl; R⁵ and R⁶ independently of one another represent hydrogen or C₁-C₆ alkyl; and R⁷ represents a 3- to 12-membered carbocyclyl, whereby the carbocyclyl can be substituted with 0, 1, 2, 3, 4 or 5 substituents independently of one another, selected from the group comprising halogen, hydroxy, C₁-C₆ alkyl and C₁-C₆ alkoxy. The invention also relates to a method for producing said pyrroles, to their use for the treatment and/or prophylaxis of diseases, in addition to their use for producing medicaments for the treatment and/or prophylaxis of diseases, notably to their use as antiviral agents, in particular against cytomegaloviruses.

WO 2004/052852 A1

(57) Zusammenfassung: Die Erfindung betrifft substituierte Pyrrole der Formel (I), in welcher R¹ für -OR⁸ oder -NR⁹R¹⁰ steht, R² für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl oder Aryl steht, wobei R² gleich Alkyl substituiert sein kann mit 0, 1, 2 oder 3 Substituenten R²⁻¹ unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Halogen, Hydroxy, C₁-C₆-Alkoxy, Hydroxycarbonyl, C₁-C₆-Alkoxy carbonyl, C₁-C₆-Alkyl carbonyloxy, Amino, C₁-C₆-Alkylamino, Aminocarbonyl, C₁-C₆-Alkylaminocarbonyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, 5- bis 10-gliedriges Heterocyclyl, C₆-C₁₀-Aryl, Phenoxy und 5- bis 10-gliedriges Heteroaryl, wobei R² gleich Aryl substituiert sein kann mit 0, 1, 2 oder 3 Substituenten R²⁻² unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Halogen, Hydroxy, Nitro, Cyano, Trifluormethoxy, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, Hydroxycarbonyl, C₁-C₆-Alkoxy carbonyl, Amino, C₁-C₆-Alkylamino, C₁-C₆-Alkylaminocarbonyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, 5- bis 10-gliedriges Heterocyclyl, C₆-C₁₀-Aryl und 5- bis 10-gliedriges Heteroaryl, R³ und R⁴ unabhängig voneinander für Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl stehen, R⁵ und R⁶ unabhängig voneinander für Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl stehen, R⁷ für 3- bis 12-gliedriges Carbocyclyl steht, wobei das Carbocyclyl substituiert sein kann mit 0, 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Halogen, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl und C₁-C₆-Alkoxy, und Verfahren zu ihrer Herstellung, ihre Verwendung zur Behandlung und/oder Prophylaxe von Krankheiten sowie ihre Verwendung zur Herstellung von Arzneimitteln zur Behandlung und/oder Prophylaxe von Krankheiten, insbesondere zur Verwendung als antivirale Mittel, insbesondere gegen Cytomegaloviren.

36 492

Judith [DE/DE]; Kreuzstr. 46, 42277 Wuppertal (DE). SCHMIDT, Thorsten [DE/DE]; Gartenstr. 187, 60596 Frankfurt (DE). REEFSCHLÄGER, Jürgen [DE/DE]; Nedderlandsweg 45, 26125 Oldenburg (DE). LANG, Dieter [DE/DE]; Wimmersbergerstr. 60, 42553 Velbert (DE). LIN, Tse-I [CN/DE]; Elisabethstr. 5, 42287 Wuppertal (DE). RADTKE, Martin [DE/DE]; Am Mergelsberg 36, 40699 Erkrath (DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER HEALTHCARE AG; Law and Patents, Patents and Licensing, 51368 Leverkusen (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (*national*): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (*regional*): ARIPO-Patent (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

- mit internationalem Recherchenbericht
- vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.